

**N-BENZYL-ACETAMIDE DERIVATIVE, ITS PREPARATION AND AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL GERMICIDE CONTAINING THE SAME AS ACTIVE CONSTITUENT**

**Patent number:** JP58026847  
**Publication date:** 1983-02-17  
**Inventor:** KIRINO OSAMU; FURUSAWA KUNHIKO; INOUE SATORU; MAEDA KIYOTO  
**Applicant:** SUMITOMO CHEMICAL CO  
**Classification:**  
- international: A01N37/18; C07C102/04; C07C103/34; C07C103/58; C07C103/737  
- european:  
**Application number:** JP19810125448 19810810  
**Priority number(s):** JP19810125448 19810810

**Report a data error here**

**Abstract of JP58026847**

**NEW MATERIAL:**A compound of formula I (R1 is alkyl branched at the alpha-position; R2 is H, lower alkyl or lower alkenyl, R1 and R2 together form alkylene; X is halogen, lower alkyl, lower alkoxy, cyano or nitro; n is an integer 1-3). **EXAMPLE:**N-(alpha'-Methyl-3,4-dichlorobenzyl)-alpha-methyl-tert-butylacetamide. **USE:**An agricultural and horticultural germicide, having a powerful effect on pathogenic microorganisms, e.g. phycomycetes and ascomycetes, greatly damaging cultivated agricultural crops, and a high controlling effect particularly on blast of rice plants, exhibiting a quick-acting and residual effect for a long term with a weak toxicity to warm-blooded animals, and scarcely remaining in the crops. **PROCESS:**An acetic acid derivative of formula II or a reactive derivative thereof, e.g. carboxylic acid or acid anhydride, is reacted with a benzylamine derivative of formula III to give the aimed compound of formula I.

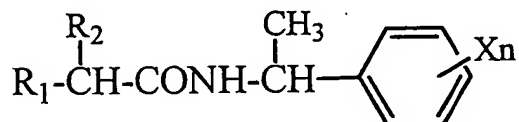
Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

Partial translation of JP 58-26847 , A

Publication date: February 17, 1983

TITLE: N-benzyl-acetamide derivatives, its production, and fungicide for agriculture and gardening containing it as the active agent

This document discloses an N-benzyl-acetamide derivative of the following formula:



wherein  $\text{R}_1$  represents an alkyl group which is branched at  $\alpha$  position;  $\text{R}_2$  represents hydrogen atom, a lower alkyl group or a lower alkenyl group, or  $\text{R}_1$  and  $\text{R}_2$  are combined to form an alkylene group;  $\text{X}$  represents a halogen atom, a lower alkyl group, a lower alkoxy group, a cyano group, or a nitro group; and  $n$  is an integer of 1-8, in claim 1.

Further, Table 1 on page 6, lower left column includes a compound of the above formula, in which  $\text{R}_1$  is  $t\text{-C}_4\text{H}_9$ ,  $\text{R}_2$  is  $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ , and  $\text{X}_n$  is 4-Cl, as compound No.15.

(END)

⑨ 日本国特許庁 (JP)

⑩ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭58-26847

⑪ Int. Cl.<sup>3</sup>  
C 07 C 103/34  
A 01 N 37/18  
C 07 C 102/04  
103/58  
103/737

識別記号  
庁内整理番号  
7375-4H  
6526-4H  
7375-4H  
7375-4H

⑬ 公開 昭和58年(1983)2月17日

発明の数 3  
審査請求 未請求

(全 8 頁)

⑭ N-ベンジルアセタミド誘導体、その製造法およびこれらを有効成分として含有する農薬用殺菌剤

⑮ 特 願 昭56-125448

⑯ 出 願 昭56(1981).8月10日

⑰ 発 明 者 桐野修

芦屋市楠町15番10-104号

⑱ 発 明 者 古沢久仁彦

豊中市本町9丁目5番25号

⑲ 発 明 者 井上悟

宝塚市中山五月台7丁目1-41  
3号

⑳ 発 明 者 前田清人

西宮市両度町4番2-106号

㉑ 出 願 人 住友化学工業株式会社

大阪市東区北浜5丁目15番地

㉒ 代 理 人 弁理士 木村勝哉

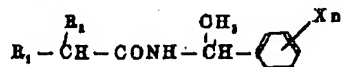
明 細 書

1. 発明の名称

N-ベンジルアセタミド誘導体、その製造法およびこれらを有効成分として含有する農薬用殺菌剤

2. 特許請求の範囲

(1) 一般式



〔式中、 $R_1$ は $\alpha$ -位分枝のアルキル基を、

$R_2$ は水素原子、低級アルキル基もしくは低

級アルケニル基または $R_1$ と $R_2$ とでアルキレ

ン基を、 $X$ はハロゲン原子、低級アルキル

基、低級アルコキシル基、シアノ基または

ニトロ基を、 $H$ は1~8の整数を表わす。〕

で示されるN-ベンジルアセタミド誘導体。

(2)  $R_1$ が炭素数6までの $\alpha$ -位分枝のアルキル

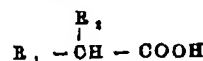
基、 $R_2$ が水素原子、炭素数1~8のアルキル

基もしくはアリル基、または $R_1$ と $R_2$ とがベン

タメチレン基あるいはヘキサメチレン基、 $X$ がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、メトキシ基、シアノ基またはニトロ基、 $H$ が1~8の整数である特許請求の範囲第1項に記載のN-ベンジルアセタミド誘導体。

(3)  $R_1$ が1-プロピル基または1-ブチル基、 $R_2$ がメチル基、エチル基または1-プロピル基、 $X$ が塩素原子、臭素原子、シアノ基またはニトロ基、 $H$ が1~8の整数である特許請求の範囲第2項に記載のN-ベンジルアセタミド誘導体。

(4) 一般式



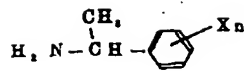
〔式中、 $R_1$ は $\alpha$ -位分枝のアルキル基を、

$R_2$ は水素原子、低級アルキル基もしくは

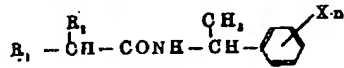
低級アルケニル基または $R_1$ と $R_2$ とでアル

キレン基を表わす。〕

で示される酢酸誘導体あるいはその反応性誘導体と一般式

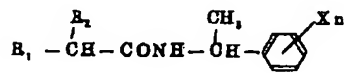


〔式中、Xはハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシル基、シアノ基またはニトロ基を、nは1～8の整数を表わす。〕  
で示されるベンジルアミン誘導体とを反応させることを特徴とする一般式



〔式中、R<sub>1</sub>はα-位分枝のアルキル基を、R<sub>2</sub>は水素原子、低級アルキル基もしくは低級アルケニル基またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>とでアルキレン基を、Xはハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシル基、シアノ基またはニトロ基を、nは1～8の整数を表わす。〕

で示されるN-ベンジルーアセタミド誘導体の製造法。



〔I〕

〔式中、R<sub>1</sub>はα-位分枝のアルキル基を、R<sub>2</sub>は水素原子、低級アルキル基もしくは低級アルケニル基またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>とでアルキレン基を、Xはハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシル基、シアノ基またはニトロ基を、nは1～8の整数を表わす。〕

で示されるN-ベンジルーアセタミド誘導体。

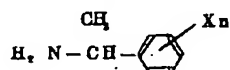
## (2) 一般式〔II〕



〔II〕

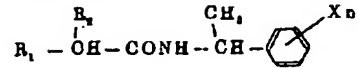
〔式中、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は前述と同じ意味を有する。〕

で示される酢酸誘導体あるいはその反応性誘導体と一般式〔III〕



〔III〕

## (5) 一般式



〔式中、R<sub>1</sub>はα-位分枝のアルキル基を、R<sub>2</sub>は水素原子、低級アルキル基もしくは低級アルケニル基またはR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>とでアルキレン基を、Xはハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシル基、シアノ基あるいはニトロ基を、nは1～8の整数を表わす。〕

で示されるN-ベンジルーアセタミド誘導体を有効成分として含有することを特徴とする農薬用殺菌剤。

## B. 発明の詳細な説明

本発明は、N-ベンジルーアセタミド誘導体、該製造法および該化合物を有効成分として含有する農薬用殺菌剤に関するものである。

さらに詳しくは本発明は

## (1) 一般式〔I〕

〔式中、Xおよびnは前述と同じ意味を有する〕

で示されるベンジルアミン誘導体とを反応させることを特徴とする一般式〔I〕で示されるN-ベンジルーアセタミド誘導体の製造法及び

(2) 一般式〔I〕で示されるN-ベンジルーアセタミド誘導体を有効成分として含有すること、を特徴とする農薬用殺菌剤である。

近年農業における作業事情から、作業の簡易化がきわめて重要な要素になりつつある。有用作物を病害から保護する農業も施用回数、減少化、すなわち一回の施用で長期にわたる高い残存効果を有する薬剤および施用方法の簡便化などの可能な薬剤の開発が要望されている。さらに農業の環境汚染も重要な問題となっており、人畜および魚類に低毒性であり、分解の早い農業が切望されているのは周知のとおりである。

本発明者らは以上の点を考慮し、研究を重ね

たところ、一般式〔I〕で示される本発明化合物が農産作物栽培上、多大な被害を与えている病原微生物、たとえば真菌類、子のう菌類、担子菌類、不完全菌類やその他細菌類に対し強い効力を有することを見出した。

中でも本発明化合物は稲の重要病害であるいもち病に高い防除効果を有することを見出すに至ったのである。さらに驚くべきことには、本発明化合物が既知いもち病殺菌剤にない速効的かつ長期にわたる残効性を示すことも見出し、本発明を完成したのである。かかる事実は従来のいもち病殺菌剤の作用および使用特性からは全く予期し得ない新事実である。

一方、温血動物、たとえばマウス、ラット、イヌ、ニワトリなどや魚類、たとえばコイ、ヒメダカなどに対する毒性はきわめて微弱であり、また本発明化合物の作物体中の残留は、ほとんど皆無といつてよい。

本発明化合物と構造が多少類似するピバリン酸アミド誘導体は、特開昭48-88228号

のアルキル基、 $R_1$ が水素原子、炭素数1~8のアルキル基もしくはアリル基または $R_2$ と $R_3$ とがペンタメチレン基またはヘキサメチレン基、 $X$ がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、メトキシ基、シアノ基またはニトロ基、 $n$ が1~8の整数であるものである。特に好ましいものとしては、 $R_1$ がイソプロピル基またはイソブチル基、 $R_2$ がメチル基、エチル基またはイソプロピル基、 $X$ が塩素原子、臭素原子、シアノ基またはニトロ基、 $n$ が1~8の整数であるものをあげることができる。

本発明化合物を製造するに当ってその出発原料となる一般式〔II〕で示される酢酸誘導体は、たとえば J. Chem. Soc., 1977, 1894 に記載されたような方法で容易に得ることができる。また一般式〔III〕で示されるベンジルアミン誘導体は、たとえば J. Am. Chem. Soc., 58, 1808 (1936) に記載されたような方法で容易に合成できる。

本発明化合物は、不斉炭素を少なくとも1個

公報およびアメリカ特許第 8,498,781 号明細書にて除草剤として公知であるが、その殺菌活性については何ら記載されていない。また特開昭54-5005号公報には $\alpha$ -ハロカルボン酸アミドが木材防腐剤として公知である。しかしながら、本発明化合物は、後述の実施例に示したように、これらの文献記載化合物よりも農圃芸用殺菌剤としてはるかにすぐれた効力を有している。

本発明は前述の新知見に基づいて完成されたもので、(1)は一般式〔I〕で示される  $N$ -ベンジルアセタミド誘導体そのもの、(2)はその製造法に関するものであり、(3)は一般式〔I〕で示される  $N$ -ベンジルアセタミド誘導体を有効成分として含有することを特徴とする農圃芸用殺菌剤である。

本発明(1)において、ハロゲン原子とはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子を被わす、合成上あるいは農圃芸用殺菌剤として好ましいものは、 $R_1$ が炭素数6までの $\alpha$ -位分枝

有し、光学異性体が存在するが、本発明はラセミ体のみならず光学異性体をも含むものであることは言うまでもない。

本発明(2)においては、一般に一般式〔II〕で示されるベンジルアミン誘導体を適当な溶媒、たとえばベンゼン、トルエン、キシレン等の炭化水素類、クロロベンゼン、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、メチルアルコール、エチルアルコール、イソプロピルアルコール等のアルコール類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、さらにはジメチルスルフォキシド、ジメチルホルムアミド、水等に溶解もしくはけんたくするかあるいは無溶媒で、好ましくはベンゼンに溶解して、0.4~1.5当量、好ましくは0.5~1.1当量の一般式〔II〕で示される酢酸誘導体あるいはその反応性誘導体を加

える。一般式〔I〕で示される酢酸誘導体あるいはその反応性誘導体を上記溶媒類に溶解もしくははんだくするかあるいは無溶媒で一般式〔II〕で示されるベンジルアミン誘導体を加えて反応を行なうことも可能である。

反応は溶媒の凝固点から沸点までの任意の温度、好ましくは0℃から溶媒の沸点までの温度で行なうことができ、必要に応じては加熱あるいは冷却することができる。

使用する一般式〔I〕で示される酢酸誘導体あるいはその反応性誘導体としては、対応するカルボン酸、酸無水物、酸塩化物、酸臭化物、カルボン酸エステル類等が可能であり、使用する一般式〔II〕で示される酢酸誘導体あるいはその反応性誘導体に応じて、適当な反応助剤、たとえば対応するカルボン酸の場合には、たとえばジクロロヘキシルカルボジイミド、五塩化リン、三塩化リン、三臭化リン、塩化チオニル、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、ナトリウムエチラート、ナトリウムメチラート、トリエチル

アミン、ピリジン、キノリン、イソキノリン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン、N-メチルモルホリン等、対応する酸塩化物あるいは酸臭化物の場合には、たとえば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、ナトリウムエチラート、ナトリウムメチラート、トリエチルアミン、ピリジン、キノリン、イソキノリン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン、N-メチルモルホリン、酢酸ナトリウム等、好ましくはトリエチルアミンを触媒量から1.5当量、好ましくは0.95~1.1当量使用するかあるいは使用せずに反応を行なうことができる。反応終了後は、反応助剤あるいはその反応生成物をろ過あるいは水洗等により除去し、溶媒を留去すれば一般式〔I〕で示されるN-ベンジルーアセタミド誘導体が純度よくしかも高収率で得られる。本製品はベンゼン、トルエン、メチルアルコール、エチルアルコール、クロロホルム、イソプロピルエーテル等で再結晶するか、あるいはカラムクロマトグラフ

を行なうことにより、さらに純化することが可能である。

本発明化合物を農薬用殺菌剤として使用する場合には、原体そのものを使用してもよい。通常使用されている形態、すなわち粉剤、散粒剤、水和剤、乳剤、油剤などのいずれの製剤形態のものでも使用できる。各製剤形態中の本発明化合物は重量比で0.1~99.9%の範囲で配合することができ、好ましくは0.2~80%である。本発明化合物を施用する場合、その範囲は10アール当り10g~1000gである。

各種製品はその目的によって適宜使いわけることが望ましい。

これらの製剤品を作成するに当って担体は固体、液体のいずれでもよい。固体としては植物性担体（たとえばコムギ粉、タバコ茎粉、ダイズ粉、クルミ殻粉、木粉、鋸屑、ふすま、樹皮粉、纖維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、纖維製品（たとえば、紙、ダンボール紙、ふるぎれ）、粉碎合成樹脂、粘土類（たとえばカオリ

ン、ペントナイト、酸性白土）、タルク類、その他無機鉱物（たとえばピロフィライト、セリサイト、軽石、硫黄粉末、活性炭）などの微粉末ないし粉状物、化学肥料（たとえば硫酸、樹安、硝安、尿素、塩安）などの微粉末をあげ得る。液体担体としては水、アルコール類（たとえばメチルアルコール、エチルアルコール）、ケトン類（たとえばアセトン、メチルエチルケトン）、エーテル類（たとえばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、テトラヒドロフラン）、芳香族炭化水素類（たとえばベンゼン、トルエン、キシレン、メチルナフタレン）、脂肪族炭化水素類（たとえばガソリン、ケロシン、灯油）、エステル類、ニトリル類、酸アミド類（たとえばメチルホルムアミド、ジメチルアセタミド）、ハロゲン化炭化水素（たとえばジクロロエタン、トリクロロエチレン、四塩化炭素）などがあげられる。次に界面活性剤の例としては、アルキル硫酸エステル類、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリースルホン酸塩、

ポリエチレングリコールエーテル類、多価アルコールエステル類などがあげられる。また、本発明で使用するこのできる固着剤や分散剤としては、カゼイン、ゼラチン、でんぷん粉、CMC、アラビヤゴム、アルギン酸、リグニンスルフォネート、ペントナイト、糖蜜、ポリビニルアルコール、松根油、寒天などがあり、安定剤としては、たとえばFAP(リン酸イソプロピル)、TCP(トリクレシルホスフェート)、トール油、エポキシ化油、各種界面活性剤、各種脂肪酸またはそのエステルなどがある。

さらに本薬剤は他の薬剤と混合して使用することができる。たとえばカスガマイシン、ポリオキシン、バリダマイシン、2,6-ジクロル-4-ニトロアニリン、ジシクロエチレンビスジチオカーバメート、2,4-ジクロル-6-(4-クロロアニリノ)-トリアジン、O,O-ジメチルO-(8-メチル-4-ニトロフェニル)ホスホロチオエート、メチルアルソン酸鉄、1,2-ビス(8-エトキシカルボニル-

2-チオウレイド)ベンゼン、1,2-ビス(8-メトキシカルボニル-2-チオウレイド)ベンゼン、メチル1-(ブチルカルバモイル)-2-ベンズイミダゾールカーバメイト、テトラクロルイソフタロニトリル、EPN、ダイアジノン、マラチオン、BPMC、クロルフェナシオン、N-(8,5-ジクロロフェニル)-1,2-ジメチルシクロプロパン-1,2-ジカルボキシイミド、(E)-1-(2,4-ジクロロフェニル)-4,4-ジメチル-2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)-1-ペンテン-8-オール、4-クロル-8-メチルベンゾチアゾロン、8-ノルマル-ブチル-β-パラ-ターシャリーブチルベンジルジチオカーボニミダート、O,O-ジメチル-O-(2,6-ジクロル-4-メチルフェニル)ホスホロチオエート、DCPA、ペンチオカーブ、CAT、O,O-ジイソプロピル8-ベンジルチオホスフェート、O-エチル、8,8-ジフェニルチオホスフェート、ジイソプロピル1,8-

ジチオラン-2-イリダンマロネート、O,O-ジメチル8-(N-メチルカルバモイルメチル)ジチオホスフェート、O,O-ジメチルO-(p-シアノフェニル)チオホスフェート、エチルp-シアノフェニルフェニルホスホノチオエート、2-メトキシ-4H-1,8,2-ベンゾジオキサホスホリン-2-スルフィドなどと混合して使用することができ、いずれも各薬剤の防除効果を減ずることはない。したがって2種以上の病害虫および雑草の同時防除が可能であり、その他の殺線虫剤、殺ダニ剤などの殺虫剤あるいは肥料と混合して使用することも可能である。

以下に配合例をあげて本発明をさらに詳細に説明するが、本発明化合物に対する添加物の種類および混合割合はこれらのみに限定されることなく、広い範囲で変更可能である。

なお、化合物名は後記例示(第1表)の番号によって示す。

#### 配合例1 粉 剤

本発明化合物(3)0.2部とクレ-99.8部とをよく粉砕混合すれば主剤含有量0.2%の粉剤を得る。使用に際してはそのまま施用してもよく、土壌と混合してもよい。

#### 配合例2 乳 剤

本発明化合物(5)2.5部、キシロール5.5部およびソルボール1200(東邦化学登録商標名)20部を混合すれば主剤含有量2.5%の乳剤を得る。使用に際しては、水で希釈して、あるいはそのまま施用してもよい。

#### 配合例3 水 和 剤

本発明化合物(6)80部、湿展剤(アルキルベンゼンスルホン酸塩系)5部およびホワイトカーボン15部をよく粉砕混合すれば主剤含有量80%の水和剤を得る。使用に際しては水で希釈して施用してもよく、土壌と混合してもよい。

#### 配合例4 ソ ル 剤

本発明化合物(7)を5μ以下にジェットミル

で粉碎したもの25部、分散剤(ポリオキシエチレンノニルフェノールエーテル)5部、分散安定剤(カルボキシメチルセルローズ)5部および水85部を攪拌混合し、さらにホモジナイザーで均一に分散混合すれば25%ゾル剤を得る。使用に際しては水で希釈して施用してもよく、そのまま施用してもよい。

次に実施例をあげ本発明をさらに詳細に説明するが、本発明はこれらにのみ限定されるものではない。

#### 実施例1 製造法

N-( $\alpha$ -メチル-8,4-ジクロロベンジル)- $\alpha$ -メチル- $\epsilon$ -ブチルアセタミド、200ml 4口フラスコにベンゼン100ml、 $\alpha$ -メチル-8,4-ジクロロベンジルアミン8.8gおよびトリエチルアミン8.0gを仕込み、室温で攪拌下、 $\alpha$ -メチル- $\epsilon$ -ブチルアセチルクロリドを逐下した。滴下終了後、反応溶液を8時間還流下に加熱攪拌した。反応終了後、反応溶液を水洗してトリ

エチルアミン塩酸塩を除き、ベンゼン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶液を減圧下に留去した。得られた残渣をエチルアルコールより再結晶して目的とする標題化合物4.7gを得た。

融点 118~119.5℃

元素分析値

計算値 C(%) 59.61 H(%) 7.00 N(%) 4.68 O(%) 23.46

(C<sub>11</sub>H<sub>11</sub>NOO<sub>2</sub>として)

実測値 59.75 6.89 4.72 23.57

以上のようにして得た化合物例を第1表に記載する。

第1表  $R_1 - \overset{R_2}{\underset{\text{OH}}{\text{CH}}} - \text{CONH} - \overset{\text{OH}}{\underset{\text{Xn}}{\text{CH}}} - \text{C}_6\text{H}_4$

| 化合物<br>番号 | R <sub>1</sub>   | R <sub>2</sub>                     | Xn                                   | 融点(°C)    |
|-----------|--|------------------------------------|--------------------------------------|-----------|
| 1         | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>    | 4-Cl                                 | 143~148.5 |
| 2         | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | H                                  | 4-Cl                                 | 90~91     |
| 3         | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | CH <sub>3</sub>                    | 4-F                                  | 87~88.5   |
| 4         | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | CH <sub>3</sub>                    | 2-Cl                                 | 194~195   |
| 5         | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | CH <sub>3</sub>                    | 4-Cl                                 | 114~116   |
| 6         | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | OH                                 | 4-Br                                 | 129~131   |
| 7         | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | CH <sub>3</sub>                    | 4-CH <sub>3</sub>                    | 121~129   |
| 8         | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | OH                                 | 4-CN                                 | 109~111.5 |
| 9         | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | OH                                 | 2-OCH <sub>3</sub>                   | 128~129   |
| 10        | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | OH                                 | 3,4-Cl <sub>2</sub>                  | 118~119.5 |
| 11        | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | CH <sub>3</sub>                    | 2,6-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | 150~152.5 |
| 12        | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | O <sub>2</sub> H                   | 4-Cl                                 | 182.5~184 |
| 13        | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | 4-NO <sub>2</sub>                    | 155~158   |
| 14        | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | 2,6,4-Cl <sub>3</sub>                | 210~212   |
| 15        | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                      | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | 4-Cl                                 | 181~183   |
| 16        | n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O<br>(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> | H                                  | 4-Cl                                 | 49.5~52   |
| 17        | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -                                   |                                    | 4-Cl                                 | 128~129   |
| 18        | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -                                   |                                    | 4-Cl                                 | 111~112   |

なお、実施例きの対照としての化合物は以下に示す。

| 類似化合物 | 構造式   | 備考  |
|-------|---|-----|
| (a)   | $t\text{-C}_4\text{H}_9\text{-CONH-CH}(\text{CH}_3)\text{-C}_6\text{H}_4$           | *   |
| (b)   | $t\text{-C}_4\text{H}_9\text{-CONH-C}(\text{CH}_3)_2\text{-C}_6\text{H}_4$          | **  |
| (c)   | $\text{BrCH}_2\text{-CONH-CH}(\text{OH})\text{-C}_6\text{H}_4$                      | *** |
| (d)   | $\text{CH}_3\text{-CH}(\text{Br})\text{-CONH-CH}(\text{CH}_3)\text{-C}_6\text{H}_4$ | *** |

\* 特開昭48-88228号公報記載化合物

\*\* アメリカ特許第3498781号明細書記載化合物

\*\*\* 特開昭54-5005号公報記載化合物



## 実施例2 イネいもち病防除試験

## 薬剤葉面施用試験(予防的散布)

9cm楠木鉢で栽培したイネ(近畿88号、4~5葉期)に前記配合例2に準じて作成した乳剤形態の供試化合物をスプレーガンを用いて15ml/1鉢の割合で散布した。散布1日後、本病原菌(*Pyricularia oryzae*)の胞子液を噴霧接種し、24~26℃、湿度90%以上の恒温室内に入れ、さらに4日後、病斑面積歩合により発病度を求め、防除効果を調べた。結果を第2表に示す。なお、防除値は次式により算出した。

$$\text{防除値} = \frac{\text{無処理区の発病度} - \text{処理区の発病度}}{\text{無処理区の発病度}} \times 100(\%)$$

第2表

| 供試化合物      | 有効成分量(ppm) | 防除値(%) |
|------------|------------|--------|
| 本発明化合物 (1) | 500        | 9.6    |
| " (2)      | 500        | 9.8    |
| " (3)      | 500        | 10.0   |
| " (4)      | 500        | 8.9    |
| " (5)      | 500        | 10.0   |
| " (6)      | 500        | 10.0   |
| " (7)      | 500        | 10.0   |
| " (8)      | 500        | 10.0   |
| " (9)      | 500        | 8.7    |
| " (10)     | 500        | 10.0   |
| " (11)     | 500        | 8.8    |
| " (12)     | 500        | 8.0    |
| " (13)     | 500        | 7.8    |
| " (14)     | 500        | 7.8    |
| " (15)     | 500        | 8.0    |
| " (16)     | 500        | 8.9    |
| " (17)     | 500        | 7.8    |
| " (18)     | 500        | 8.9    |
| 類縁化合物 (a)  | 500        | 0      |
| " (b)      | 500        | 0      |
| " (c)      | 500        | 0      |
| " (d)      | 500        | 0      |
| 市販殺菌剤*     | 500        | 8.0    |
| 無処理        | —          | 0      |

\* 0,0-ジイソプロピル 8-ベンジルチオホスフェート(48%乳剤)

## 実施例8 イネいもち病防除試験

## 薬剤葉面施用試験(予防的散布)

9cm楠木鉢で栽培したイネ(近畿88号、4~5葉期)に前記配合例2に準じて作成した乳剤形態の供試化合物をスプレーガンを用いて15ml/1鉢の割合で散布した。散布4日後本病原菌(*Pyricularia oryzae*)の胞子液を噴霧接種し、24~26℃、湿度90%以上の恒温室内に入れ、さらに4日後病斑面積歩合により発病度を求め、防除効果を調べた。結果を第3表に示す。なお、防除値の算出は実施例2と同様にした。

第3表

| 供試化合物      | 有効成分量(ppm) | 防除値(%) |
|------------|------------|--------|
| 本発明化合物 (1) | 500        | 9.5    |
| " (2)      | 500        | 10.0   |
| " (3)      | 500        | 9.1    |
| " (7)      | 500        | 10.0   |
| " (8)      | 500        | 9.6    |
| " (10)     | 500        | 10.0   |
| 市販殺菌剤*     | 500        | 2.5    |
| 無処理        | —          | 0      |

\* 0,0-ジイソプロピル 8-ベンジルチオホスフェート(48%乳剤)

第 4 表

## 実施例4 リンゴ黒腐病防除試験

9 cm 植木鉢で栽培したリンゴ実生 (品種: 田光 第2本葉) に前記配合例2に準じて作成した乳剤形態の供試化合物を80 ml/1鉢の割合で散布した。散布1日後、本病原菌 (*Venturia inaequalis*) の胞子液を噴霧接種し、15℃、湿度90%以上の恒温室内に8日間置き、つづいて15℃強光灯照明下で10日間静置し、発病させた。発病程度は病斑面積歩合により発病度を求め、防除効果を調べた。結果を第4表に示す。

なお、防除率の算出は実施例2と同様にした。

| 供試化合物      | 有効成分量 (ppm) | 防除率 (%) |
|------------|-------------|---------|
| 本発明化合物 (a) | 500         | 94      |
| (b)        | 500         | 89      |
| (c)        | 500         | 90      |
| (d)        | 500         | 91      |
| (e)        | 500         | 95      |
| 市販殺菌剤*     | 500         | 92      |
| 無処理        | —           | 0       |

\* テトラクロロイソフタロニトリル (75% 水和剤)

## 実施例5 ダイコン萎黄病防除試験

第 5 表

ダイコン萎黄病菌 (*Fusarium oxysporum f. raphani*) 汚染土壌を直径12 cmの鉢につめ、ダイコン (品種: 早生40日) 種子を1鉢あたり15粒ずつ播種した。播種後、本発明化合物の前記配合例2に準じて作成した乳剤を20 ml/1鉢の割合で土壌灌注した。その後温室で12日間栽培後発芽、生育した苗を地際より切り取り、道管部褐変の有無を調査した。発病度は下記の式により算出した。

$$\text{発病度} = \frac{\text{道管部褐変苗数}}{\text{調査苗数}} \times 100 (\%)$$

| 供試化合物      | 有効成分量 (ppm) | 発病度 (%) |
|------------|-------------|---------|
| 本発明化合物 (a) | 500         | 26.5    |
| (b)        | 500         | 24.1    |
| (c)        | 500         | 25.8    |
| (d)        | 500         | 16.8    |
| 市販殺菌剤*     | 500         | 25.1    |
| 無処理        | —           | 100.0   |

\* 3-ヒドロキシ-5-メチルイソオキサゾール (80%液剤)